

First Hit

L8: Entry 10 of 22

File: EPAB

May 4, 2000

PUB-NO: DE019849514A1

DOCUMENT-IDENTIFIER: DE 19849514 A1

TITLE: Sun protection agent contains coco glyceride, isoamyl p-methoxycinnamate, 3-benzophenone, phenyl benzimidazole sulfonic acid, micronized ambiphilic titanium dioxide, tromethamine and water

PUBN-DATE: May 4, 2000

## INVENTOR-INFORMATION:

NAME	COUNTRY
SCHADE, HEINZ-BENNO	DE

## ASSIGNEE-INFORMATION:

NAME	COUNTRY
BUNDESREP DEUTSCHLAND	DE

APPL-NO: DE19849514

APPL-DATE: October 27, 1998

PRIORITY-DATA: DE19849514A (October 27, 1998)

INT-CL (IPC): A61K 7/42

## ABSTRACT:

CHG DATE=20001116 STATUS=O>Sun protection agent consists of 5-10 wt. % coco glyceride, 3-6 wt. % isoamyl p-methoxycinnamate, 1-4 wt. % 3-benzophenone, 1-4 wt. % phenyl benzimidazole sulfonic acid, 2-8 wt. % micronized, ambiphilic titanium dioxide with low photocatalytic activity and 0.5-3 wt. % tromethamine, rest additives and water.

First Hit**End of Result Set**

L1: Entry 1 of 1

File: EPAB

May 4, 2000

PUB-NO: DE019849514A1

DOCUMENT-IDENTIFIER: DE 19849514 A1

TITLE: Sun protection agent contains coco glyceride, isoamyl p-methoxycinnamate, 3-benzophenone, phenyl benzimidazole sulfonic acid, micronized ambiphilic titanium dioxide, tromethamine and water

PUBN-DATE: May 4, 2000

## INVENTOR-INFORMATION:

NAME	COUNTRY
SCHADE, HEINZ-BENNO	DE

## ASSIGNEE-INFORMATION:

NAME	COUNTRY
BUNDESREP DEUTSCHLAND	DE

APPL-NO: DE19849514

APPL-DATE: October 27, 1998

PRIORITY-DATA: DE19849514A (October 27, 1998)

INT-CL (IPC): A61K 7/42

## ABSTRACT:

CHG DATE=20001116 STATUS=O>Sun protection agent consists of 5-10 wt. % coco glyceride, 3-6 wt. % isoamyl p-methoxycinnamate, 1-4 wt. % 3-benzophenone, 1-4 wt. % phenyl benzimidazole sulfonic acid, 2-8 wt. % micronized, ambiphilic titanium dioxide with low photocatalytic activity and 0.5-3 wt. % tromethamine, rest additives and water.

101785260



①⑨ BUNDESREPUBLIK  
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES  
PATENT- UND  
MARKENAMT

⑫ **Offenlegungsschrift**  
⑬ **DE 198 49 514 A 1**

⑤① Int. Cl.<sup>7</sup>:  
**A 61 K 7/42**

⑳ Aktenzeichen: 198 49 514.5  
㉔ Anmeldetag: 27. 10. 1998  
㉕ Offenlegungstag: 4. 5. 2000

DE 198 49 514 A 1

⑦① Anmelder:

Bundesrepublik Deutschland, vertreten durch das  
Bundesministerium der Verteidigung, vertreten  
durch das Bundesamt für Wehrtechnik und  
Beschaffung, 56068 Koblenz, DE

⑦② Erfinder:

Schade, Heinz-Benno, Dr.rer.biol.hum., 41836  
Hückelhoven, DE

⑤⑥ Entgegenhaltungen:

DE 197 16 070 A1  
US 57 33 531 A  
EP 08 95 775 A1

Chem.Abstr. 124:185099j (1996);  
Chem.Abstr. 118:154080t (1993);

**Die folgenden Angaben sind den vom Anmelder eingereichten Unterlagen entnommen**

Prüfungsantrag gem. § 44 PatG ist gestellt

⑤④ Sonnenschutzmittel

⑤⑦ Das neue Sonnenschutzmittel soll derart ausgebildet  
sein, daß in kostengünstiger und hautverträglicher Weise  
ein hoher UVA- und UVB-Schutz erzielt wird.

Hierzu besteht das Sonnenschutzmittel aus:

- 5-10 Gewichtsprozent Cocoglycerides,
- 3-6 Gewichtsprozent Isoamyl p-Methoxycinnamate,
- 1-4 Gewichtsprozent Benzophenone-3,
- 1-4 Gewichtsprozent Phenylbenzimidazole Sulfonic  
Acid,
- 2-8 Gewichtsprozent mikronisiertes, ambiphiles Titani-  
um Dioxide mit geringer photokatalytischer Aktivität,
- 0,5-3 Gewichtsprozent Tromethamine,
- Rest Zusatzstoffe und Wasser.

DE 198 49 514 A 1

Die Erfindung betrifft ein Sonnenschutzmittel. Das grundsätzliche Problem zunehmend stärkerer Sonneneinstrahlung auf die Erdoberfläche aufgrund verschiedenster Einflüsse und daraus resultierend eine erhöhte Belastung mit UVA- und UVB-Strahlung ist allgemein bekannt. Weltweit wird von anerkannten Dermatologen in diesem Zusammenhang postuliert, daß ein Schutz vor den beiden UV-Strahlenspektren auch die Gefahr des Erwerbs einer bösartigen Hauterkrankung, wie beispielsweise eines Melanoms minimiert wird. Ein notwendiger hoher Schutzfaktor ist praktisch nur noch durch die Kombination organisch-chemischer mit mikrofeinen Mineralpigmenten erreichbar, da der Einsatz von nur chemischen Absorbieren ohne mineralische Reflektionsmittel so hohe Einsatzkonzentrationen bedingen würde, daß das Risiko allergisierender und sensibilisierender Effekte exponentiell stiege. Ferner ist zu bedenken, daß gemäß neueren Untersuchungen die Resorption durch die Haut eine nicht zu vernachlässigende systemische Belastung des Körpers mit den Schutzsubstanzen bedingt; auch hier steigt der Effekt mit zunehmender Substanzkonzentration sehr stark an.

Im Handel werden die verschiedensten Rezepturbestandteile zur Bildung von Sonnenschutzmitteln angeboten. Die Rezepturbestandteile betreffen zum einen Wachse, Fette, Öle, zum anderen Feuchtigkeitsmittel, ferner UV-Filter und Reflektionsmittel, wie auch Emulgatoren, Hautpflegestoffe, Parfümöle und Konservierungsstoffe.

Der Erfindung liegt die Aufgabe zugrunde, ein Sonnenschutzmittel derart auszubilden, daß in kostengünstiger und hautverträglicher Weise ein hoher UVA- und UVB-Schutz erzielt wird.

Diese Aufgabe wird erfindungsgemäß durch ein Sonnenschutzmittel mit den Merkmalen des Patentanspruchs 1 gelöst.

Die Vorteile der Erfindung bestehen darin, daß trotz dermatologischer Unbedenklichkeit und geringer Kosten ein hoher Lichtschutzfaktor erzielt wird. Cocoglycerides ist ein Kokosölderivat, das ein eher langsames bis mittleres Spreitvermögen aufweist. Es besitzt die Eigenschaft, in überragendem Maße den verwendeten UV-Filterkomplex aus Benzophenone-3 und Isoamyl p-Methoxycinnamate zu solubilisieren, so daß man im Vergleich zu anderen Ölen neben der höheren galenischen Stabilität bei sinkender Kristallisationsneigung auch größere Lichtschutzfaktoren der Gesamtzubereitung bei ansonsten gleichem Filtergehalt erzielt in einer Emulsion liegt Cocoglycerides als extrem feinverteiltes Fett mit kleiner Tropfengröße und hohem Dispersionsgrad vor; auch dieser Umstand unterstützt galenisch die hohe Filterpräsentation auf der Haut und erhöht damit die Lichtschutzwirkung der Zubereitung. Isoamyl p-Methoxycinnamate hat eine gute UVB-Schutzwirkung. Ferner stellt auch Isoamyl p-Methoxycinnamate ein vorzügliches Lösungsmittel für den UV-Filter Benzophenone-3 dar. Benzophenone-3 weist sowohl UVA- wie auch UVB-Schutzeigenschaften auf. Obgleich Benzophenone-3 galenisch nicht unproblematisch ist, da dieser Stoff in Wasser unlöslich sowie in den meisten Lipiden zumindest schwerlöslich ist, gelingt die Solubilisierung mit den vorgenannten Komponenten Cocoglycerides und Isoamyl p-Methoxycinnamate wie zuvor dargelegt. Um durch eine in der Wasserphase gelöste Filtersubstanz die Lichtschutzwirkung der Gesamtzubereitung zu verbessern, wird Phenylbenzimidazole Sulfonic Acid eingesetzt Phenylbenzimidazole Sulfonic Acid stellt eine wasserunlösliche Säure dar, die mit Tromethamine in ihr Salz und damit in die wasserlösliche Form umgesetzt wird. Gleichzeitig weist Tromethamine eine Pufferwirkung auf und kann

insofern eine längere Aufrechterhaltung des neutralen pH-Wertes gewährleisten, ohne daß die Formulierung vorsorglich auf unphysiologische, also alkalische Bereiche eingestellt werden müßte, um die Assoziation und damit Rekristallisation der Sulfonsäure zu verhindern. Im Verarbeitungsprozeß weist Tromethamine den Vorteil einer kurzen Herstellungszeit der Wasserphase auf, da keine gasförmigen Reaktionsprodukte entstehen.

Um die Konzentration an chemischen UV-Filtersubstanzen reduzieren zu können und gleichzeitig den als immer bedeutsamer für die Schutzwirkung der Gesamtzubereitung angesehenen UVA-Schutz zu erhöhen, wird als Reflektionsmittel ein Titanoxid eingesetzt, das mit Simethicon und Aluminiumoxid verschnitten oder beschichtet ist. Diese Veredelungskomponenten bewirken eine Ambiphibie des Pigmentes, so daß eine Dispersion in Wasser und Öl gleichermaßen möglich ist.

Diese optimale Benetzbarkeit verringert in einer Wasser-in-Öl-Emulsion die Weißelneigung, die durch die Mikronisierung ohnehin vergleichsweise niedrig ist. Die photokatalytische Aktivität des eingesetzten Pigmentes ist gering.

Zusammenfassend gelingt es durch den Synergismus der vier Filtersubstanzen, bei niedrigen Substanzkonzentrationen und somit niedriger resorptiver Belastung beim Anwender, einen hohen Schutzgrad im gesamten UVA- und UVB-Spektralbereich zu erhalten; die kosmetischen Produkteigenschaften sind dennoch sehr gut und es tritt kein Weißeln auf.

Gemäß einer Ausgestaltung der Erfindung basiert das Emulgatorsystem auf zwei Dodecyl Glycol Copolymeren, von denen das eine als echter Emulgator, das andere als Emulsionsstabilisator und Coemulgator dient. Beide Dodecyl Glycol Copolymere gehören zur Gruppe der Polyalkylenglycole und stellen Wasser-in-Öl-Emulgatoren bzw. Stabilisatoren solcher Emulsionen dar. Die erhaltene Wasser-in-Öl-Emulsion begünstigt im Gegensatz zu einer Öl-in-Wasser-Emulsion das Weißeln der Creme bei Wasserkontakt nicht, da man das Weißeln durch die verminderte Benetzbarkeit des Pigments mit Wasser unterdrückt. Ferner ist eine Wasser-in-Öl-Zubereitung leichter dauerhaft wasserfest zu formulieren. Durch die erhaltene Hydrophobie werden das Abwaschen der Formulierung vermindert und die Hauthaftung erhöht. Dies bedingt eine geringere Notwendigkeit der Wiederholungsapplikation auch bei Wasser- und Schweißeinwirkung.

Gemäß einer weiteren Ausgestaltung der Erfindung ist vorgesehen, hinsichtlich der Fettphase Oleyl Erucate, Dicaprylyl Ether und Cyclomethicone zu verwenden. Mit den vorgenannten Komponenten erreicht man, daß die Fettphase langsam-, mittelstark- und schnellspreitende Öle umfaßt. Diese Mischung erzeugt ein langanhaltendes, von Anfang an spürbares Glättegefühl. Bei unausgewogener Zusammensetzung der Fettphase kann die Zubereitung einen fettigen, klebrigen oder auch nichtpflegenden Eindruck hinterlassen, der sich auf die Compliance negativ auswirkt. Oleyl Erucate stellt ein synthetisches Jojobawachs dar und weist ein langsames Spreitvermögen auf. Dennoch zieht es schnell ein, ist sehr hautaffin und hinterläßt einen hohen Pflegeeindruck. Dicaprylyl Ether ist ein schnellspreitender Ether und als sogenanntes trockenes Öl einzustufen. Die Viskosität ist wassergleich und es hinterläßt auf der Haut keinen fühlbaren Fettfilm. Cyclomethicone weist ähnliche sensorische Eigenschaften wie Dicaprylyl Ether auf. Es hinterläßt kein Fettgefühl auf der Haut und dient zur Erhöhung der Wasserfestigkeit der Gesamtzubereitung.

Ein Ausführungsbeispiel der Erfindung wird nachfolgend näher beschrieben.

Zusammensetzung eines Sonnenschutzmittels, wobei die

angegebenen Gewichtsprozentangaben geringfügig unter- oder überschritten werden können:

- 8,0 Gewichtsprozent Cocoglycerides,
- 6,0 Gewichtsprozent Oleyl Erucate,
- 4,0 Gewichtsprozent Dicaprylyl Ether,
- 3,0 Gewichtsprozent Hydrogenated Castor oil,
- 2,0 Gewichtsprozent Cethyl Palmitate,
- 1,0 Gewichtsprozent Cyclomethicone,
- 3,0 Gewichtsprozent Glycerine,
- 4,0 Gewichtsprozent Isoamyl p-Methoxycinnamate,
- 2,0 Gewichtsprozent Benzophenone-3,
- 2,0 Gewichtsprozent Phenylbenzimidazole Sulfonic Acid,
- 4,0 Gewichtsprozent Titanium Dioxide mit Alumina und mit Simethicone als festes Mischprodukt oder Blend,
- 3,0 Gewichtsprozent PEG 45-/Dodecyl Glycol Copolymer,
- 3,0 Gewichtsprozent Methoxy PEG-22-/Dodecyl Glycol Copolymer,
- 0,2 Gewichtsprozent Allantoin,
- 1,0 Gewichtsprozent Tromethamine,
- 0,2 Gewichtsprozent Parfum,
- 0,5 Gewichtsprozent Phenoxyethanol,
- Rest Wasser.

Das vorgenannte Sonnenschutzmittel kann wie folgt hergestellt werden:

Der Herstellungsgang wird beschrieben für einen Ansatz von ca. 100–130 kg Fertigprodukt in einer FRYMA®-Salbenmaschine mit heizbarem Kessel und einem Flügelrührer mit Abstreifer sowie einem Spalthomogenisator.

1. Die vorgewogene Substanzen der Fettphase werden zusammen auf ca. 80°C aufgeschmolzen und erhitzt (Cocoglycerides, Oleyl Erucate, Dicaprylyl Ether, Hydrogenated Castor Oil, Cetyl Palmitate, Cyclomethicone, beide Dodecyl Glycol Copolymere).
2. Zur Klarschmelze werden Benzophenone-3 und Isoamyl p-Methoxycinnamate gegeben, kurze Homogenisation der Phase.
3. Anlegen eines Vakuums an den Kessel, Aktivierung von Rührer und Homogenisator. Einsaugen des Titanoxid-Compamdpulvers unter Rühren/Homogenisieren zur gleichmäßigen Dispersion.
4. Herstellen der Wasserphase in einem zweiten Kessel. Aqua, Glycerol, Allantoin, Phenylbenzimidazole Sulfonic Acid, Tromethamine werden zusammengegeben, bis zur völligen Klarheit der Lösung gerührt; evtl. muß mehr Tromethamine zur Neutralisation der Sulfonsäure zugegeben werden.
5. Die ca. 75–80°C-warme Wasserphase wird analog 3. in den Kessel zur Fettphase gesaugt; Rührer und Homogenisator bleiben auf höchster Stufe aktiviert, bis die gesamte Wasserphase eingearbeitet ist und daran anschließend 2 min.
6. Aktives Herunterkühlen des Ansatzes auf Raumtemperatur (Homogenisator aus (nur eingeschaltet auf höchster Stufe, wenn bei ca. 40°C Phenoxyethanol und Parfum zugesaugt werden [analog 3. über Zugabetrichter])). Rührer auf langsamer Stufe, dito Abstreifer, während des gesamten Kühlvorganges.
7. Abfüllung in Tuben, deren Verschluß (Gewindestück und Verschlußkappe) nicht aus Metall besteht, da hier durch den Pigmentanteil Schmirgel- und Abrasionseffekte am Tubenmetall beim Öffnen und Schließen der Tube auftreten (schwarzer Abrieb im Gewinde).

Zusammenfassend dargestellt, weist das vorgenannte Sonnenschutzmittel folgende Eigenschaften auf:

– Mit der vorgenannten Rezeptur ist die Maschinenfähigkeit gewährleistet.

– Ein nach der Rezeptur hergestelltes Sonnenschutzmittel weist eine hohe Stabilität auf. Die galenische Stabilität sowohl bei Wärme- (45°C über 6 Monate) als auch bei Kältebelastung (10 Tau-Gefrierzyklen) wird durch den Emulgatorkomplex (Dodecylglycolcopolymer + Glycerol und Cetylpalmitat als Stabilisatoren bzw. Coemulgatoren) erreicht, die Solubilisierung und Verhinderung der Rekristallisation von Benzophenone-3 garantiert der Synergismus von Cocoglycerides und Isoamyl p-Methoxycinnamate. Die Mikronisation sowie die Ambiphibie verhindern wirksam eine Pigment-sedimentation. Die Pigmente bzw. Filtersubstanzen sind photokatalytisch praktisch inaktiv und im hohen Maße photolyse stabil.

– Das Sonnenschutzmittel erfüllt die sensorischen Anforderungen wie angenehmes Auftragen und gute Entnehmbarkeit aus der Tube, auch bei tiefen Temperaturen und auf nasser Haut, ohne zu kleben oder einen sichtbaren Weißeffekt zu erzeugen. Dies wird in der vorliegenden Rezeptur durch den Emulsionstyp, den hohen Gehalt an gelösten Stoffen in der Wasserphase sowie den Zusatz von Glycerin erreicht. Die Zubereitung ist somit im Winter wie im Sommer gleichermaßen universell einsetzbar.

– Die Zubereitung ist aufgrund des Emulsionstyps sowie des Zusatzes von Cyclomethicone (hier ein kurz-kettiges) trotz eines Wasseranteiles von > 50% absolut wasser- und schweißfest

– Die Rezeptur kommt weitestgehend ohne die bekannten potentiellen Allergene und ohne Mineralölprodukte wie Vaseline etc. aus.

– Die Faktorkombination wirkt in perfektem Maße untereinander sowie mit der Fettphase synergistisch, so daß ein UVA- und UVB-Schutz mit einem Schutzfaktor von mehr als 20 bei sehr niedrigen Filtersubstanzkonzentrationen erreicht wird.

– Die Creme ist durch ihre Auftrageigenschaften wie hohe Spreitneigung und gute Verteilbarkeit sparsam im Auftrag und daher sehr ergiebig.

– Die Herstellung erweist sich als unaufwendig, da sowohl das ansonsten nicht unproblematisch zu verarbeitende Pigment problemlos ohne Herstellung einer Vordispersion direkt in den Ansatz gegeben werden kann, andererseits die Wasserphase durch einfache Mischung der Komponenten herstellbar ist.

Die einzelnen Bestandteile der vorgenannten Rezeptur sind entsprechend der Nomenklatur nach INCI definiert. Hinsichtlich der Ausführbarkeit der Erfindung erzielt man besonders gute Resultate mit folgenden, aus dem Markt erhältlichen Produkten, um das vorgenannte Sonnenschutzmittel herzustellen:

- Als Cocoglycerides wurde "MYRITOL 331®" der Fa. Henkel-Cospha eingesetzt.
- Als Oleyl Erucate eignet sich "CETIOL J 600®" der Fa. Henkel-Cospha.
- Als Cyclomethicone eignet sich "BELSIL CM 040®" der Fa. Wacker-Chemie.
- Als Titanium Dioxide/Alumina/Simethicone-Blend wurde "EUSOLEX T-2000®" der Fa. Merck eingesetzt.
- Als PEG 45-/Dodecyl Glycol Copolymer eignet sich besonders "ELFACOS ST 9®" als Methoxy PEG-22/Dodecyl Glycol Copolymer "ELFACOS E 200®", beide Fa. AKZO.

## Patentansprüche

1. Sonnenschutzmittel, bestehend aus:
  - 5-10 Gewichtsprozent Cocoglycerides,
  - 3-6 Gewichtsprozent Isoamyl p-Methoxycin- 5  
namate,
  - 1-4 Gewichtsprozent Benzophenone-3,
  - 1-4 Gewichtsprozent Phenylbenzimidazole  
Sulfonic Acid,
  - 2-8 Gewichtsprozent mikronisiertes, ambiphi- 10  
les Titanium Dioxide mit geringer photokatalyti-  
scher Aktivität
  - 0,5-3 Gewichtsprozent Tromethamine,
  - Rest Zusatzstoffe und Wasser.
2. Sonnenschutzmittel nach Anspruch 1, mit folgen- 15  
den Zusatzstoffen:
  - 2-5 Gewichtsprozent PEG 45-/Dodecyl Glycol  
Copolymer,
  - 2-5 Gewichtsprozent Methoxy PEG 22-/Dode- 20  
cyl Glycol Copolymer.
3. Sonnenschutzmittel nach Anspruch 1 oder 2, mit  
folgenden Zusatzstoffen:
  - 4-8 Gewichtsprozent Oleyl Erucate,
  - 2-8 Gewichtsprozent Dicaprylyl Ether,
  - 0,5-5 Gewichtsprozent Cyclomethicone. 25

30

35

40

45

50

55

60

65